

PCT/EPO4/11228

Ministero delle Attività Produttive

Direzione Generale per lo Sviluppo Produttivo e la Competitività Ufficio Italiano Brevetti e Marchi

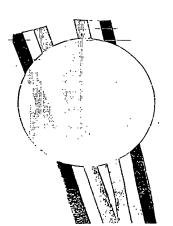
Ufficio G2



Autenticazione di copia di documenti relativi alla domanda di brevetto della INVENZIONE INDUSTRIALE N. MI 2003 A 001941 depositata il 09.10.2003.

Si dichiara che l'unita copia è conforme ai documenti originali depositati con la domanda di brevetto sopra specificata, i cui dati risultano dall'accluso processo verbale di deposito.

D 7 OTT. 2004



IL FUNZIONARIO

IL PEPOSITANTE

ritolb							
"Composizioni f	armaceutic	che topi	che per i	trattam	ento del	le derma	titi"
	•					•	
							
PASSUNTO							
							
Composizioni	farmaceut	tiche	per la	sommin	istrazi	one to	pica,
comprendenti c	ome ingre	diente a	attivo Te	lmestein	a, in m	iscela c	on un
comprendenti c veicolo adatto	ome ingred	diente a per il	attivo Te trattam	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,
comprendenti c veicolo adatto dermatite alle	ome ingred o, utili ergica da	diente a per il contatta	attivo Te trattam o, dermat	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,
	ome ingred o, utili ergica da	diente a per il contatta	attivo Te trattam o, dermat	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,
comprendenti c veicolo adatto dermatite alle	ome ingred o, utili ergica da	diente a per il contatta	attivo Te trattam o, dermat	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,
comprendenti c veicolo adatto dermatite alle	ome ingred o, utili ergica da	diente a per il contatta	attivo Te trattam o, dermat	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,
comprendenti c veicolo adatto dermatite alle	ome ingred o, utili ergica da	diente a per il contatta	attivo Te trattam o, dermat	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,
comprendenti c veicolo adatto dermatite alle	ome ingred o, utili ergica da	diente a per il contatta	attivo Te trattam o, dermat	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,
comprendenti c veicolo adatto dermatite alle	ome ingred o, utili ergica da	diente a per il contatta	attivo Te trattam o, dermat	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,
comprendenti c veicolo adatto dermatite alle	ome ingred o, utili ergica da	diente a per il contatta	attivo Te trattam o, dermat	lmestein mento di	a, in m dermat	iscela c	on un pica,

M. DISEGNO



7122 M Descrizione dell'invenzione industriale avente per titolo: M 200 3 A 0 0 1 9 4 91

MaB/mc "COMPOSIZIONI FARMACEUTICHE TOPICHE

TRATTAMENTO DELLE DERMATITI"

a nome : SINCLAIR PHARMACEUTICALS LIMITED

con sede in : Godalming-Surrey (Gran Bretagna)

090TT. 26:3

IL

PER

La presente invenzione ha per oggetto composizioni farmaceutiche per la somministrazione topica comprendenti come ingrediente attivo Telmesteina, in miscela con un veicolo adatto.

Le composizioni farmaceutiche topiche della presente invenzione sono utili per il trattamento di dermatite atopica, dermatite allergica da contatto, dermatite seborroica, dermatite da radiazioni, psoriasi, xerosi e atopia.

Le dermatiti sono infiammazioni superficiali della cute, caratterizzate da comparsa di vescicole, eritema, edema, essudazione, lesioni di tipo squamoso o crostoso e intenso prurito. Esistono vari tipi di dermatiti: la dermatite da contatto, provocata da sostanze irritanti con le quali la pelle viene a contatto o da sostanze non irritanti, ma verso le quali il soggetto è allergico; la dermatite atopica, caratterizzata da forte prurito e andamento cronico; la dermatite seborroica, un'affezione di tipo squamoso che colpisce principalmente volto e cuoio capelluto. Il trattamento consiste in teoria nell'allontanamento dell'agente eziologico, che tuttavia in molti casi non è identificato o non può essere rimosso. La terapia utilizzata è pertanto quella a base di corticosteroidi, che tuttavia presentano controindicazioni ben note: riduzione delle difese immunitarie, con conseguenti episodi di infezione, soprattutto da funghi e Candida; necessità di sospensione graduale del

trattamento; impossibilità di utilizzazione durante la fase acuta essudativa, effetto rebound alla sospensione del trattamento. Inoltre i corticosteroidi non dovrebbero essere utilizzati per periodi di tempo prolungati, soprattutto nei bambini, poiché possono dare luogo ad effetti sistemici.

I trattamenti alternativi, a base di olii vegetali idrogenati o petrolio idrofilo, o di shampoo medicati (a base di zinco-piridione, solfuro di selenio, zolfo ecc.) nel caso delle dermatiti seborroiche, non danno risultati risolutivi.

La Telmesteina, descritta nel brevetto italiano n. 1.215.469, è il derivato acilato all'azoto dell'acido 4-tiazolidincarbossilico: la presenza del gruppo carbetossi conferisce alla molecola lipofilia nettamente superiore e quella del composto originale. La Telmesteina, utilizzata in terapia come mucolitico, svolge azione antiradicalica e protettrice nei confronti degli agenti ossidanti responsabili dei danni all'epidermide, oltre a inibire l'azione dell'elastasi e della collagenasi.

Si è ora trovato che la Telmesteina esercita un'azione efficace nel trattamento di dermatite atopica, dermatite allergica da contatto, dermatite seborroica, dermatite da radiazioni, psoriasi, xerosi e atopia.

Le composizioni farmaceutiche topiche della presente invenzione conterranno la Telmesteina in miscela con un veicolo adatto farmacologicamente accettabile.

La Telmesteina sarà presente nelle composizioni farmaceutiche topiche della presente invenzione preferibilmente in concentrazioni tra lo 0.01 e il 5% in peso.

Le composizioni della presente invenzione potranno inoltre contenere altri ingredienti attivi, che svolgano un'azione complementare o comunque

utile nel trattamento di dermatite atopica, dermatite allergica da contatto, dermatite seborroica, dermatite da radiazioni, psoriasi, xerosi e atopia.

Le composizioni farmaceutiche topiche della presente invenzione potranno essere in forma di crema, gel, lozione, sospensione, spray o pomata.

La posologia sarà determinata dal medico; a titolo di esempio si potranno effettuare una o più applicazioni giornaliere, anche per periodi di tempo prolungati.

Si riportano di seguito alcuni esempi di formulazioni secondo la presente invenzione.

Esempio 1 - CREMA DI TELMESTEINA ALLO 0.01% IN PESO

	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
Telmesteina	0.010
Sodio ialuronato	0.100
Etilesil palpitato	10.100
Glicol pentilenico	6.000
Alcol arachidilico, alcol beenilico, arachidil glucoside	4.500
Gliceril stearato, PEG-100 stearato	4.500
Glicol butilenico	4.500
Capriloil glicina	2.500
Tocoferil acetato	1.200
Carbomer	1.700
Etilesilglicerina	1.600
Piroctone olamina	0.500
Sodio idrossido	0.387
Allantoina	0.850
DMDM idantoina	0.300
EDTA sale disodico	0.080
Tetraesildecil ascorbato	0.050
Propil gallato	0.020
Acqua	61.103
Totale	100.000

Esempio 2 - CREMA DI TELMESTEINA ALLO 0.01% IN PESO

Telmesteina 0.010 Etilesil palpitato 11.000 Glicol pentilenico 7.000 Alcol arachidilico, alcol beenilico, arachidil glucoside 4.000 Gliceril stearato, PEG-100 stearato 4.000 Glicol butilenico 4.000 Capriloil glicina 2.500 Tocoferil acetato 2.000 Acido salicilico 1.000 Sodio idrossido 0.785 Carbomer 1.800 Etilesilglicerina 0.600 Allantoina 0.300 EDTA sale disodico 0.080 Tetraesildecil ascorbato 0.050 Propil gallato 0.020 Acqua 59.805 Totale 100.000		
Etilesil palpitato 11.000 Glicol pentilenico 7.000 Alcol arachidilico, alcol beenilico, arachidil glucoside 4.000 Gliceril stearato, PEG-100 stearato 4.000 Glicol butilenico 4.000 Capriloil glicina 2.500 Tocoferil acetato 2.000 Acido salicilico 1.000 Sodio idrossido 0.785 Carbomer 1.800 Etilesilglicerina 0.600 Allantoina 0.300 EDTA sale disodico 0.080 Tetraesildecil ascorbato 0.050 Propil gallato 0.020 Acqua 59.805		0.010
Glicol pentilenico	Etilesil palpitato	11,000
Alcol arachidilico, alcol beenilico, arachidil glucoside Gliceril stearato, PEG-100 stearato Glicol butilenico Capriloil glicina Tocoferil acetato Acido salicilico Sodio idrossido Carbomer Etilesilglicerina Allantoina DMDM idantoina DMDM idantoina EDTA sale disodico Tetraesildecil ascorbato Propil gallato Acqua Totale	Glicol pentilenico	7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7
Gliceril stearato, PEG-100 stearato	Alcol arachidilico, alcol beenilico, arachidil glucoside	
Glicol butilenico	Gliceril stearato, PEG-100 stearato	
Capriloil glicina 2.500 Tocoferil acetato 2.000 Acido salicilico 1.000 Sodio idrossido 0.785 Carbomer 1.800 Etilesilglicerina 0.600 Allantoina 0.300 EDTA sale disodico 0.080 Tetraesildecil ascorbato 0.050 Propil gallato 0.020 Acqua 59.805	Glicol butilenico	52 2
Tocoferil acetato 2.000 Acido salicilico 1.000 Sodio idrossido 0.785 Carbomer 1.800 Etilesilglicerina 0.600 Allantoina 0.300 EDTA sale disodico 0.080 Tetraesildecil ascorbato 0.050 Propil gallato 0.020 Acqua 59.805	Capriloil glicina	1840 P
Acido salicilico 1.000 Sodio idrossido 0.785 Carbomer 1.800 Etilesilglicerina 0.600 Allantoina 0.385 DMDM idantoina 0.030 EDTA sale disodico 0.080 Tetraesildecil ascorbato 0.050 Propil gallato 0.020 Acqua 59.805	Tocoferil acetato	MARCAIN BOLLOI
Sodio idrossido	Acido salicilico	IOW - NA
Carbomer 1.800 Etilesilglicerina 0.600 Allantoina 0.300 DMDM idantoina 0.300 EDTA sale disodico 0.080 Tetraesildecil ascorbato 0.050 Propil gallato 0.020 Acqua 59.805	Sodio idrossido	1000
Etilesilglicerina 0.600 Allantoina 0.300 DMDM idantoina 0.300 EDTA sale disodico 0.080 Tetraesildecil ascorbato 0.050 Propil gallato 0.020 Acqua 59.805	Carbomer	SALE E
Allantoina DMDM idantoina EDTA sale disodico Tetraesildecil ascorbato Propil gallato Acqua Totale 10.330 10.300 10.300 10.330 10.30	Etilesilglicerina	
DMDM idantoina EDTA sale disodico Tetraesildecil ascorbato Propil gallato Acqua Totalo Totalo	Allantoina	
EDTA sale disodico Tetraesildecil ascorbato Propil gallato Acqua 59.805	DMDM idantoina	100000000000000000000000000000000000000
Tetraesildecil ascorbato Propil gallato Acqua 59.805	EDTA sale disodico	With the state of
Propil gallato Acqua 59.805	Tetraesildecil ascorbato	
Acqua 59.805	Propil gallato	1. 10 23 France
Totala	Acqua	
	Totale	100.000

Esempio 3 - CREMA DI TELMESTEINA AL 2% IN PESO

Telmesteina	2.000
Etilesil palmitato	10.000
Glicol pentilenico	6.100
Alcol arachidilico, alcol beenilico, arachidil glucoside	5.000
Gliceril stearato, PEG-100 stearato	4.000
Glicol butilenico	4.000
Capriloil glicina	2.500
Tocoferil acetato	1.000
Sodio idrossido	0.762
Carbomer	0.700
Etilesilglicerina	0.600
Piroctone olamina	0.500
Allantoina_	0.350
DMDM idantoina	0.300
Sodio-ialuronato	0.100
EDTA sale disodico	0.080
Tetraesildecil ascorbato	0.050
Propil-gallato	0.020
Acqua	61.938
Totale	100.000

Le composizioni della presente invenzione hanno dimostrato di essere

ottimamente tollerate. Esse non contengono sostanze allergeniche, né derivati di origine animale (quali lanolina, cera d'api, grasso animale), né conservanti (quali parabeni, isotiazolinoni, derivati fenolici, e simili) che sono spesso responsabili delle dermatiti allergiche da contatto.

Pertanto, grazie alle caratteristiche sopra indicate, le composizioni della presente invenzione sono indicate per il trattamento di reazioni cutanee allergiche già instaurate, nella prevenzione di forme ricorrenti, e come coadiuvanti nel trattamento di patologie croniche quali dermatite atopica, dermatite allergica da contatto, dermatite seborroica, dermatite da radiazioni, psoriasi, xerosi e atopia.

Più particolarmente, le composizioni della presente invenzione sono indicate nel trattamento di patologie quali dermatiti di tipo irritativo ed eczematoso, come idratanti e lenitivi per pelli sensibili e delicate; nelle irritazioni allergiche da farmaci, detergenti, solventi; negli eritemi dovuti a esposizione eccessiva ai raggi solari; in caso di punture d'insetto, arrossamenti di varia origine, irritazioni post-rasatura, lievi scottature, iperreattività cutanea; come normalizzanti dopo trattamenti di medicina estetica, quali peeling con acido glicolico o laserterapia.

La presente invenzione ha inoltre per oggetto l'uso di Telmesteina per la preparazione di un medicamento topico per il trattamento di dermatite atopica, dermatite allergica da contatto, dermatite seborroica, dermatite da radiazioni, psoriasi, xerosi e atopia.

RIVENDICAZIONI

- 1. Uso della Telmesteina per la preparazione di un medicamento topico per il trattamento per il trattamento di dermatite atopica, dermatite allergica da contatto, dermatite seborroica, dermatite da radiazioni, psoriasi, xerosi e atopia.
- 2. Composizione farmaceutica per la somministrazione topica, comprendente come ingrediente attivo Telmesteina in miscela con un veicolo adatto.
- 3. Composizione farmaceutica secondo la rivendicazione 2, in forma di crema, gel, lozione, sospensione, spray o pomata.

Milano, 9 ottobre 2003

Il Mandatario (Bianchetti Marina) di Bianchetti Bracco Minoja S.r.l.

Mi ou chelk



Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/EP04/011228

International filing date:

07 October 2004 (07.10.2004)

Document type:

Certified copy of priority document

Document details:

Country/Office: IT

Number:

MI2003 A 001941

Filing date:

09 October 2003 (09.10.2003)

Date of receipt at the International Bureau: 24 January 2005 (24.01.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in

compliance with Rule 17.1(a) or (b)

